



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3678644 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 9/19 (2006.01)

A61K 9/08 (2006.01)

A61K 47/02 (2006.01)

A61K 47/26 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.07.24
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.05.03
(86)	European Application Nr.	18762107.3
(86)	European Filing Date	2018.09.06
(87)	The European Application's Publication Date	2020.07.15
(30)	Priority	2017.09.08, EP, 17190117 2017.12.15, EP, 17207771
(84)	Designated Contracting States:	AL; AT; BE; BG; CH; CY; CZ; DE; DK; EE; ES; FI; FR; GB; GR; HR; HU; IE; IS; IT; LI; LT; LU; LV; MC; MK; MT; NL; NO; PL; PT; RO; RS; SE; SI; SK; SM; TR
	Designated Extension States:	BA; ME
	Designated validation states	MA; TN
(73)	Proprietor	Bayer Pharma Aktiengesellschaft, Müllerstrasse 178, 13353 Berlin, Tyskland Bayer Consumer Care AG, Peter Merian-Strasse 84, 4052 Basel, Sveits
(72)	Inventor	FREUNDLIEB, Julia, Heidkopf 24, 44229 Dortmund, Tyskland JACOBS, Tia, Nüller Str. 90, 42115 Wuppertal, Tyskland
(74)	Agent or Attorney	RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

(54)	Title	FORMULATIONS OF COPANLISIB
(56)	References Cited:	WO-A1-2017/134030

Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

Patentkrav

1. Stabilt, lyofilisert, copanlisibholdig faststoff, egnet for fortynning og for terapeutiske anvendelser, faststoffet omfattende:
 - 5 • copanlisib, spesielt i en mengde egnet som en terapeutisk dose,
 - ett eller flere pH-justerende midler, som er et buffermiddel som omfatter en svak syre, slik som for eksempel sitronsyre, og en sterk base, slik som for eksempel natriumhydroksid, og
 - et fyllmiddel, hvori fyllmidlet er mannitol,
- 10 faststoffet har en pH på mellom 4 og 5 (inklusive) når det rekonstitueres med et egnet fortynningsmiddel, slik som sterilt vann for injeksjon eller steril vandig natriumkloridløsning, spesielt for eksempel 0,9 % vandig natriumkloridløsning, den terapeutiske dosen er 30, 45 eller 60 mg copanlisib.
- 15 2. Det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet ifølge krav 1, hvori buffermidlet er sitronsyre og natriumhydroksid.
3. Det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet ifølge krav 1 eller 2, som inneholder sitronsyre i en mengde på 0,7–75 vekt-%, spesielt 1,5–30 vekt-%, spesielt 2,98 vekt-%,
20 av det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet.
4. Det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, som inneholder natriumhydroksid i en mengde på 0–6 vekt-%, spesielt 3,3–4,0 vekt-%, spesielt 3,7 vekt-%, av det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet.
25
5. Det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, som inneholder natriumhydroksid i en mengde på 0,01–6 vekt-%, spesielt 3,3–4,0 vekt-%, spesielt 3,7 vekt-%, av det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet.
- 30 6. Det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, som inneholder mannitol i en mengde på 15,4–82,1 vekt-%, spesielt 30,8–82,1 vekt-%, spesielt 61,6 vekt-%, av det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet.
7. Det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet ifølge et hvilket som helst av kravene
35 1 til 6, som inneholder den copanlisibfrie basen i en mengde på 7,7–92,4 vekt-%, spesielt 7,7–61,6 vekt-%, spesielt 30,8 vekt-%, av lyofilisert, copanlisibholdig faststoff.

8. Det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvori:

- den terapeutiske dosen av copanlisib er i en mengde på 30,8 vekt-% av det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet,

5 • sitronsyren er i en mengde på 2,98 vekt-% av det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet,

- natriumhydroksidet er i en mengde på 3,7 vekt-% av det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet, og

10 • mannitolen er i en mengde på 61,6 vekt-% av det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet,

det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet, når det rekonstitueres med et egnet fortynningsmiddel, slik som sterilt vann for injeksjon eller steril vandig natriumkloridløsning, spesielt 0,9 % vandig natriumkloridløsning, for eksempel, som har en pH på mellom 4 og 5 (inklusive).

15

9. Det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvori:

- den terapeutiske dosen av copanlisib er i en mengde på 30, 45 eller 60 mg,

- sitronsyren er i en mengde på 5,8 mg,

20 • natriumhydroksidet er i en mengde på 6,3 mg, og

- mannitolen er i en mengde på 120 mg,

det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet, når det rekonstitueres med et egnet fortynningsmiddel, slik som sterilt vann for injeksjon eller steril vandig natriumkloridløsning, spesielt 0,9 % vandig natriumkloridløsning, for eksempel, som har en pH på mellom 4 og 5 (inklusive).

25

10. Det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 9, hvori:

- den terapeutiske dosen av copanlisib er i en mengde på 80 mg,

30 • sitronsyren er i en mengde på 7,7 mg,

- natriumhydroksidet er i en mengde på 8,4 mg, og

- mannitolen er i en mengde på 160 mg,

det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet, når det rekonstitueres med et egnet fortynningsmiddel, slik som sterilt vann for injeksjon eller steril vandig natriumkloridløsning, spesielt 0,9 % vandig natriumkloridløsning, for eksempel, som har en pH på mellom 4 og 5 (inklusive).

35

11. Det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10, som er et pulver eller en kake.

5 12. Det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11, som er inneholdt i en beholder, særlig en forseglet beholder, særlig en injeksjonsflaske, mer spesielt en 6 ml injeksjonsflaske.

13. Det lyofiliserte, copanlisibholdige faststoffet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 12, som inneholder copanlisib i en mengde på 68,4 mg.

10

14. Lyofilisert, copanlisibholdig faststoff ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13, for anvendelse i behandlingen eller profylaksen av kreft, spesielt et non-Hodgkins lymfom (NHL), slik som 1. linje, 2. linje, eller opptil 9 tidligere behandlinger, relapsert, refraktær, indolent NHL, spesielt follikulært lymfom (FL), marginalsonelymfom (MZL), lite lymfatisk lymfom (SLL), lymfoplasmacytoid/Waldenströms makroglobulinemi (LPL-WM), eller aggressiv NHL, spesielt diffust storcellet B-cellelymfom (DLBCL), mantelcellelymfom (MCL), perifert T-cellelymfom (PTCL), transformert lymfom (TL) eller kronisk lymfatisk leukemi (KLL), som monoterapi eller i kombinasjon med ett eller flere immunterapeutiske, kjemoterapeutiske eller immunkjemoterapeutiske midler mot kreft.

15